



Bescheinigung

Die Beiersdorf Aktiengesellschaft in Hamburg/Deutschland hat eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen mit vermindertem Klebrigkeitsgefühl, enthaltend Glycerinester von α -Hydroxycarbonsäuren und gesättigten Fettsäuren".

am 22. Januar 1998 beim Deutschen Patent- und Markenamt eingereicht.

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig das Symbol A 61 K 7/40 der Internationalen Patentklassifikation erhalten.

München, den 18. November 1998
Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

Im Auftrag

A handwritten signature in black ink, appearing to be 'Brand'.

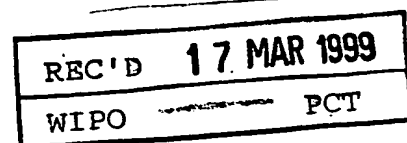
Brand

Aktenzeichen: 198 02 204.2

011582160

0000 MUL 2 2 OT4109 0000 0000

This Page Blank (uspto)



**PRIORITY
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



PCT/EP99/00056

EJU

Bescheinigung

EP 99/00056

Die Beiersdorf Aktiengesellschaft in Hamburg/Deutschland hat
eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen
mit vermindertem Klebrigkeitsgefühl, enthaltend
Glycerinester von α -Hydroxycarbonsäuren und ge-
sättigten Fettsäuren"

am 22. Januar 1998 beim Deutschen Patent- und Markenamt ein-
gereicht.

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wieder-
gabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig
das Symbol A 61 K 7/40 der Internationalen Patentklassifikation
erhalten.

München, den 18. November 1998
Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

Im Auftrag

Aktenzeichen: 198 02 204.2

Brand

**Beiersdorf Aktiengesellschaft
Hamburg**

5

Beschreibung

**Kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen mit vermindertem
Klebrigkeitsgefühl, enthaltend Glycerinester von α -Hydroxycarbonsäuren und
gesättigten Fettsäuren**

10

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen mit vermindertem Klebrigkeitsgefühl, Verfahren zu ihrer Herstellung sowie die Verwendung von Wirkstoffen zur Herabminderung des Klebrigkeitsgefühles kosmetischer Zubereitungen.

15

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z.B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z.B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

20

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

25

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

30

Medizinische Zusammensetzungen enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Pro-

dukten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

5 Häufige Erscheinungsformen kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen sind feindisperse Mehrphasensysteme, in welchen eine oder mehrere Fett- bzw. Ölphasen neben einer bzw. mehreren Wasserphasen vorliegen. Von diesen Systemen sind wiederum die eigentlichen Emulsionen die am weitesten verbreiteten.

10 Insbesondere Zubereitungen zur kosmetischen oder therapeutischen Hautpflege enthalten als wesentliche Bestandteile Abmischungen aus Ölen bzw. öllöslichen Substanzen und Wasser bzw. wasserlöslichen Substanzen. Bestimmte Bestandteile der Wasserphase, z.B. Glycerin, aber auch der Ölphase, z.B. Tocopherylacetat wirken sich in höheren Konzentrationen negativ auf die sensorischen Eigenschaften der Zubereitungen aus. Oft äußert sich dies in einem gesteigerten Klebrigkeitsgefühl oder auch Schmierigkeitsgefühl bei der Anwendung entsprechender Zubereitungen, welche dann im Einzelfalle nicht vermarktungsfähig sein können, da sie vom Verbraucher nicht akzeptiert bzw. negativ beurteilt werden.

20 Es ist zwar bekannt, durch Hinzufügen bestimmter Substanzen, beispielsweise einiger ausgewählter Puderrohstoffe, insbesondere Talkum, dieses Klebrigkeitsgefühl oder auch Schmierigkeitsgefühl zu reduzieren. Davon abgesehen, daß dieses nur selten vollständig gelingt, wird durch einen solchen Zusatz auch die Viskosität des betreffenden Produktes verändert und die Stabilität verringert.

30 Aufgabe war daher, all diesen den Nachteilen des Standes der Technik Abhilfe zu schaffen. Insbesondere sollten Produkte mit verringerter Klebrigkeit bzw. Schmierigkeit zur Verfügung gestellt werden. Produkte auf dem Gebiete der pflegenden Kosmetik, der dekorativen Kosmetik und der pharmakologischen Galenik sollten gleichermaßen von den geschilderten Nachteilen des Standes der Technik befreit werden.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Grundlagen für kosmetische Zubereitungen zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen.

35 Ferner war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Produkte mit einer möglichst breiten Anwendungsvielfalt zur Verfügung zu stellen. Beispielsweise sollten Grundlagen für Zubereitungsformen wie Reinigungsemulsionen, Gesichts- und Körperpflegezubereitungen

gen, aber auch ausgesprochen medizinisch-pharmazeutische Darreichungsformen geschaffen werden, zum Beispiel Zubereitungen gegen Akne und andere Hauterscheinungen.

5 Erstaunlicherweise werden all diese Aufgaben gelöst durch kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen, durch folgende Merkmale gekennzeichnet:

sie enthalten

- (I) einen oder mehrere partiell neutralisierte Ester von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure,
- 10 (II) einen oder mehrere Fettalkohole gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen
- (III) sie stellen O/W-Emulsionen dar.

Erfindungsgemäß ist ferner die Verwendung von Kombinationen aus

- 15 (I) einem oder mehreren partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure,

sowie

- (II) einem oder mehreren Fettalkoholen, gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen,
- 20 zur Herstellung nicht-klebriger O/W-Emulsionen bzw. die Verwendung solcher Kombinationen zur Verminderung der Klebrigkeit von O/W-Emulsionen.

Ein besonders vorteilhafter Citronensäureester ist das Glycerylstearatcitrat. Solche Citronensäureester sind beispielsweise erhältlich unter der Produktbezeichnung „IMWILTOR® 370“ der Gesellschaft Hüls AG.

Die Gesamtmenge an einem oder mehreren partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure in den fertigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen wird vorteilhaft aus dem Bereich

30 von 0,1 - 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 6,0 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Bevorzugter, erfindungsgemäß verwendeter Fettalkohol ist der Cetyl-Stearylalkohol (ein Gemisch aus Hexadecanol-1 und Octadecanol-1 zu etwa gleichen Anteilen).

Die Gesamtmenge an einem oder mehreren erfindungsgemäß verwendeten Fettalkoholen in den fertigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen wird vorteilhaft aus dem Bereich von 0,1 - 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 6,0 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

5

Es ist erfindungsgemäß vorteilhaft, Gewichtsverhältnisse von Glycerinestern von α -Hydroxycarbonsäuren und gesättigten Fettsäuren einerseits und Fettalkoholen andererseits von 7 : 3 bis 3 : 7 zu wählen, bevorzugt von 2 : 1 bis 1 : 2, insbesondere bevorzugt von etwa 1 : 1.

10

Erfindungsgemäß ist es möglich und vorteilhaft, den Anteil der Ölphase der erfindungsgemäßen Zubereitungen im Bereich von 5 bis 40 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, frei zu wählen.

15 Als Grundbestandteile der erfindungsgemäßen Zubereitungen können verwendet werden:

- Wasser oder wäßrige Lösungen
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- 20 - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

30 Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Die Ölphase der Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten

35 und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen

und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoleicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

5 Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

10 Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

15 Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisnonanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

20 Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z.B. in Form einer Hautschutzcrème, einer Hautlotion, einer kosmetischen Milch, beispielsweise in Form einer Sonnenschutzcreme oder einer Sonnenschutzmilch, sind vorteilhaft und enthalten z.B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

25 Es ist dem Fachmanne natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

30 Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

35 Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der

Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z.B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

5

Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, die erfindungsgemäß verwendeten Kombinationen aus Glycerinestern von α -Hydroxycarbonsäuren und gesättigten Fettsäuren einerseits und Fettalkoholen andererseits als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten.

10

Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcrème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

15

Günstig sind auch solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorzugsweise enthalten diese neben dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff zusätzlich mindestens eine UVA-Filtersubstanz und/oder mindestens eine UVB-Filtersubstanz und/oder mindestens ein anorganisches Pigment.

20

Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden beispielsweise in Tagescrèmes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

25

Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

30

Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure-(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Trianiino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin

Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z.B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze,
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

- Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Filtersubstanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-tert. Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es kön-

nen die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

5 Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid.
10 Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel,
15 Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.
20

Es ist vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung weitere antiirritative oder antientzündliche Wirkstoffe zuzugeben, insbesondere Batylalkohol (α -Octadecylglycerylether), Selachylalkohol (α -9-Octadecenylglycerylether), Chimylalkohol (α -Hexadecylglycerylether), Bisabolol und/oder Panthenol.
25

Es ist ebenfalls vorteilhaft, den Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung übliche Antioxidantien zuzufügen. Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.
30

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und
35

deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α -Carotin, β -Carotin, ψ -Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Furfurylidensorbitol und dessen Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 - 20 Gew.-%, insbesondere 1 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Liegen die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung in Form einer Lotion vor, die ausgespült und z.B. vor oder nach der Entfärbung, vor oder nach der Shampoonierung, zwischen zwei Shampoonierungsschritten, vor oder nach der Dauerwellbehandlung angewendet wird, so handelt es sich dabei z.B. um wäßrige oder wäßrig-alkoholische Lösungen, die gegebenenfalls oberflächenaktive Substanzen enthalten, bevorzugt nicht-ionische oder kationische oberflächenaktive Substanzen, deren Konzentration zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,2 und 5 Gew.-%, liegen kann. Diese kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen können auch Aerosole mit den üblicherweise dafür verwendeten Hilfsmitteln darstellen.

Eine kosmetische Zubereitung in Form einer Lotion im Sinne der vorliegenden Erfindung, die nicht ausgespült wird, insbesondere eine Lotion zum Einlegen der Haare, eine Lotion, die beim Fönen der Haare verwendet wird, eine Frisier- und Behandlungslotion, stellt im allgemeinen eine wäßrige, alkoholische oder wäßrig-alkoholische Lösung dar und enthält mindestens ein kationisches, anionisches, nicht-ionisches oder amphoter Polymer oder auch Gemische derselben, sowie die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen. Die Menge der verwendeten Polymeren liegt z.B. zwischen 0,1 und 10 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,1 und 3 Gew.-%.

Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung zur Behandlung und Pflege der Haare, die den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff enthalten, können als Emulsionen vorliegen, die vom nicht-ionischen oder anionischen Typ sind. Nicht-ioni-

sche Emulsionen enthalten neben Wasser Öle oder Fettalkohole, die beispielsweise auch polyethoxyliert oder polypropoxyliert sein können, oder auch Gemische aus den beiden organischen Komponenten. Diese Emulsionen enthalten gegebenenfalls kationische oberflächenaktive Substanzen.

5

Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung zur Behandlung und Pflege der Haare können als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäßen Wirkstoff und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z.B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z.B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

10

15

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen.

Beispiel 1

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Paraffinöl | 5,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 2

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Paraffinöl | 40,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 3

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Paraffinöl | 9,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 4

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Paraffinöl | 14,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 5

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Paraffinöl | 19,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 6

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,00 |
| Paraffinöl | 24,00 |
| Cetylstearylalcohol | 2,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 7

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Ethanol | 3,00 |
| Glycerin | 3,00 |
| Isohexadecan | 2,00 |
| Caprylic/Capric Triglyceride | 2,00 |
| Paraffinöl | 2,00 |
| Glycerylstearatcitrat | 1,80 |
| Cetylstearylalcohol | 1,80 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Carbomer | 0,10 |
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 8

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Glycerin | 5,00 |
| Caprylic/Capric Triglyceride | 5,00 |
| Ethanol | 3,00 |
| Paraffinöl | 3,00 |
| Microcrystallines Wachs, Paraffinöl | 3,00 |
| Cyclomethicon | 2,00 |
| Dimethicon | 2,00 |
| Octyldodecanol | 2,00 |
| Glycerylstearatcitrat | 1,80 |
| Cetylstearylalcohol | 1,80 |
| Carbomer | 0,20 |
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Bisabolol | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Beispiel 9

| | Gew.-% |
|--|-----------|
| Caprylic/Capric Triglyceride | 3,50 |
| Glycerin | 3,00 |
| Glycerylstearatcitrat | 2,40 |
| Cetylstearylalcohol | 2,40 |
| Isohexadecan | 2,00 |
| Paraffinöl | 2,00 |
| Octylmethoxycinnamat | 1,30 |
| Aluminum Starch Octenylsuccinate | 1,00 |
| Dimethicon | 1,00 |
| Extrakt von Glycyrrhiza glabra | 0,50 |
| NaEDTA | 0,50 |
| Butylmethoxydibenzoylmethan | 0,40 |
| Carbomer | 0,20 |
| Wollwachsalkohol | 0,10 |
| Tocopherylacetat | 0,10 |
| Farbstoffe, Parfum, Konservierungsmittel | q.s. |
| Wasser | ad 100,00 |

Patentansprüche

1. Kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen, durch folgende Merkmale gekennzeichnet:

5 Sie enthalten

- (I) einen oder mehrere partiell neutralisierte Ester von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure sowie
- (II) einen oder mehrere Fettalkohole gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen
- 10 (III) sie stellen O/W-Emulsionen dar.

2. Verwendung von Kombinationen aus

- (I) einem oder mehreren partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure

15 sowie

- (II) einem oder mehreren Fettalkoholen, gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen, zur Herstellung nicht-klebriger O/W-Emulsionen oder zur Verminderung der Klebrigkeit von O/W-Emulsionen.

20

3. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß als partiell neutralisierter Ester von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure das Glycerylstearatcitrat gewählt wird.

4. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß als Fettalkohol der Cetyl-Stearylalkohol gewählt wird.

5. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Gesamtmenge an einem oder mehreren partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure in den Zubereitungen gewählt wird aus dem Bereich von 0,1 - 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 6,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

30

6. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Gesamtmenge an einem oder mehreren Fettalkoholen in den fer-

35

tigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen gewählt wird aus dem Bereich von 0,1 - 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 6,0 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

- 5 7. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß Gewichtsverhältnisse von partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure einerseits und Fettalkoholen andererseits gewählt werden aus dem Bereich von 7 : 3 bis 3 : 7, bevorzugt von 2 : 1 bis 1 : 2, insbesondere bevorzugt von etwa 1 : 1.

10

8. Zubereitungen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß der Anteil der Ölphase der erfindungsgemäßen Zubereitungen im Bereich von 5 bis 40 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, gewählt wird.

15

Zusammenfassung

Kosmetische oder pharmazeutische Zubereitungen, durch folgende Merkmale gekennzeichnet: Sie enthalten:

- 5 (I) einen oder mehrere partiell neutralisierten Estern von Monoglyceriden und/oder Diglyceriden gesättigter Fettsäuren mit Zitronensäure,
- (II) einen oder mehrere Fettalkohole gewählt aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylalkohole mit 12 bis 40 Kohlenstoffatomen,
- (III) und sie stellen O/W-Emulsionen dar.

This Page Blank (uspto)